

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference ONF-5057PCT	FOR FURTHER ACTION	See item 4 below
International application No. PCT/JP2004/009071	International filing date (<i>day/month/year</i>) 22 June 2004 (22.06.2004)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 23 June 2003 (23.06.2003)
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237		
Applicant ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.		

1.	This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a).																								
2.	<p>This REPORT consists of a total of 10 sheets, including this cover sheet.</p> <p>In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.</p>																								
3.	<p>This report contains indications relating to the following items:</p> <table style="width: 100%; border: none;"> <tr> <td style="width: 10%; text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td style="width: 20%;">Box No. I</td> <td style="width: 70%;">Basis of the report</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. II</td> <td>Priority</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. III</td> <td>Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. IV</td> <td>Lack of unity of invention</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. V</td> <td>Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. VI</td> <td>Certain documents cited</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VII</td> <td>Certain defects in the international application</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. VIII</td> <td>Certain observations on the international application</td> </tr> </table>	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. I	Basis of the report	<input type="checkbox"/>	Box No. II	Priority	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. IV	Lack of unity of invention	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VI	Certain documents cited	<input type="checkbox"/>	Box No. VII	Certain defects in the international application	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VIII	Certain observations on the international application
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. I	Basis of the report																							
<input type="checkbox"/>	Box No. II	Priority																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. IV	Lack of unity of invention																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VI	Certain documents cited																							
<input type="checkbox"/>	Box No. VII	Certain defects in the international application																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VIII	Certain observations on the international application																							
4.	The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).																								

<p style="text-align: center;">The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland</p> <p>Facsimile No. +41 22 740 14 35</p>	<p>Date of issuance of this report 03 January 2006 (03.01.2006)</p> <p>Authorized officer Masashi Honda</p> <p>Telephone No. +41 22 338 70 10</p>
--	---

特許協力条約

発信人 日本国特許庁 (国際調査機関)

REC'D 07 OCT 2004

WIPO

PCT

出願人代理人

大家 邦久

様

あて名

〒 103-0013

東京都中央区日本橋人形町2丁目14番6号
セルパ人形町6階 大家特許事務所

PCT

国際調査機関の見解書
(法施行規則第40条の2)
[PCT規則43の2.1]発送日
(日.月.年)

05.10.2004

出願人又は代理人
の書類記号

ONF-5057PCT

今後の手続きについては、下記2を参照すること。

国際出願番号

PCT/JP2004/009071

国際出願日

(日.月.年) 22.06.2004

優先日

(日.月.年) 23.06.2003

国際特許分類 (IPC) Int. Cl. C07D215/08, 217/06, 471/04, 487/04, 471/14, 471/10, A61K31/47, 31/472, 31/437, 31/4375, 31/4376, 31/438, A61P1/00, 11/06, 25/08, 25/20, 25/22, 25/24, 3/00, 5/16, 9/00, 13/00, 15/00, 17/00, 19/00, 27/00, 29/00, 35/00

出願人 (氏名又は名称)

小野薬品工業株式会社

1. この見解書は次の内容を含む。

☒ 第I欄 見解の基礎☐ 第II欄 優先権☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成☒ 第IV欄 発明の単一性の欠如☒ 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明☒ 第VI欄 ある種の引用文献☐ 第VII欄 国際出願の不備☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

2. 今後の手続き

国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国際予備審査機関がPCT規則66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書を国際予備審査機関の見解書とみなさない旨を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。

この見解書が上記のように国際予備審査機関の見解書とみなされる場合、様式PCT/ISA/220を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。

さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。

3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。

見解書を作成した日

14.09.2004

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

板本 佳子

4P

9638

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

様式PCT/ISA/237 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 見解の基礎

1. この見解書は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎として作成された。

- ☐ この見解書は、_____ 語による翻訳文を基礎として作成した。
それは国際調査のために提出された PCT 規則 12.3 及び 23.1(b) にいう翻訳文の言語である。

2. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、以下に基づき見解書を作成した。

a. タイプ ☐ 配列表

☐ 配列表に関連するテーブル

b. フォーマット ☐ 書面

☐ コンピュータ読み取り可能な形式

c. 提出時期 ☐ 出願時の国際出願に含まれる

☐ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された

☐ 出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された

3. ☐ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

4. 補足意見：

1. 次に、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☐ 国際出願全体

- 請求の範囲 21

☒ この国際出願又は請求の範囲 21 は、国際予備審査をすることを要しない
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 2 1 は手術又は治療による人体の処置方法に係るものである。

- ☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 _____ の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

- ☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 _____ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

- ☒ 請求の範囲
 . 2 1
について、国際調査報告が作成されていない。

- ☐ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

- ☐ 提出されていない。
☐ 所定の基準を満たしていない。
☐ 提出されていない。
☐ 所定の基準を満たしていない。

- ☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- ☐ 提出されていない。
☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

- ☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 追加手数料納付の求め（様式PCT/ISA/206）に対して、出願人は、

- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☐ 追加手数料の納付はなかった。

2. ☒ 国際調査機関は、発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際調査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲1～13に記載される化合物群に共通する化学構造は、国際調査報告のC欄に提示した文献に記載されるように公知であり、また、当該化学構造を有する化合物がうつ病、不安、睡眠障害等の疾患の治療に有用であることも知られているから、当該化学構造が先行技術に対して貢献する技術的特徴であるとはいえない。

したがって、請求の範囲1～20及び22は、特別な技術的特徴を共有するものとはいえないから、これらの一群の発明は単一の一般的発明概念を形成するように連関しているものとはすることができない。

4. したがって、国際出願の次の部分について、この見解書を作成した。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 1-20, 22 に関する部分

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	6-8, 13	有
	請求の範囲	1-5, 9-12, 14-20, 22	無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-20, 22	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-20, 22	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明

(文献)

1. JP 2001-072679 A (アディール エ コンパニー) 2001.03.21
2. WO 2002/053565 A1 (小野薬品工業株式会社) 2002.07.11
3. GB 1444980 A (VSESOJUZNY NAUCHNOISLEDovATELSKY KHIMIKO-FARMATSEVTICHESKY INSTITUT IMENIS. ORDZHONIKIDZE) 1976.08.04
4. WO 2002/081471 A1 (NOVARTIS-ERFINDUNGEN VERWALTUNGSGESELLSCHAFT M.B.H.) 2002.10.17
5. WO 2002/064590 A2 (LILLY ICOS LLC) 2002.08.22
6. WO 2002/064591 A2 (LILLY ICOS LLC) 2002.08.22
7. WO 2001/087038 A2 (ORTHO-MCNEIL PHARMACEUTICAL, INC.) 2001.11.22
8. WO 97/43287 A1 (ICOS CORPORATION) 1997.11.20
9. WO 2002/088123 A1 (LILLY ICOS LLC) 2002.11.07
10. JP 09-508113 A (ラボラトワール、グラクソ、ウェルカム、ソシエテ、アノニム) 1997.08.19
11. Journal of Medicinal Chemistry, 2000, Vol.43, No.8, p.1577-1585
12. Journal of Organic Chemistry, 1994, Vol.59, No.11, p.3219-22

(説明)

請求の範囲1～5及び9～12について

請求の範囲1～5及び9～12に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1～12から新規性及び進歩性を有しない。文献1及び5～12には請求の範囲5に記載の式(I-3)で表される化合物が、文献3には請求の範囲1～3に記載された化合物が、文献2及び4には請求の範囲1に記載された化合物がそれぞれ記載されている。

(補充欄に続く)

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書(PCT規則43の2.1及び70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 2003/068753 A1 [EX]	21. 08. 2003	13. 02. 2003	14. 02. 2002

2. 書面による開示以外の開示(PCT規則43の2.1及び70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲3～9は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT第5条の意味において開示されているのは、これらの請求の範囲に記載された化合物のごくわずかな部分にすぎず、PCT第6条の意味で十分に裏付けられているとはいえない。

よって、明細書に開示され、裏付けられている部分、すなわち、請求の範囲5に記載の一般式(I-3)においてBが環状基である化合物を中心に行った調査に基づいて、見解を示した。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

また、請求の範囲 1～5 及び 9～12 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 1 及び 2 より進歩性を有しない。文献 1 には、請求の範囲 1～5 及び 9～12 に記載の化合物を包含する化合物群がうつ病や不安症、睡眠障害等の疾患の予防や治療に有用であることが、文献 2 には、請求の範囲 1～4 に記載の化合物を包含する化合物群がうつ病、不安障害、過敏性大腸症候群等の疾患の予防や治療に有用であることがそれぞれ記載されている。そして、医薬の分野において、薬理活性を有する化合物中の一部の構造を適宜変えて薬理活性の改善等を図ることは、通常行われていることであるから、文献 1 又は 2 に記載の化合物群に該当する化合物やその一部の構造を適宜変えた化合物を実際に製造し、上記疾患の治療活性を確認してみることは当業者にとっては自明のものである。

請求の範囲 6～8 及び 13 について

請求の範囲 6～8 及び 13 に係る発明は、国際調査報告で引用された何れの文献にも開示されておらず、新規性を有するが、国際調査報告で引用された文献 1 より進歩性を有しない。文献 1 には、請求の範囲 5 に記載の式 (I-3) で表される化合物を包含する化合物群がうつ病や不安症、睡眠障害等の疾患の予防又は治療に有用であることが記載されている。そして、医薬の分野において、薬理活性を有する化合物中の一部の構造を適宜変えて薬理活性の改善等を図ることは、通常行われていることであるから、文献 1 に記載の化合物において、置換基等の一部の構造を適宜変えた化合物を製造し、上記疾患の治療活性を確認してみることは当業者にとっては自明のものである。

請求の範囲 14 について

請求の範囲 14 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 1～9 から新規性及び進歩性を有しない。文献 1～9 には、請求の範囲 1～5 及び 9～12 のいずれかに記載の化合物が医薬として有用であることが記載されている。

請求の範囲 15～20 及び 22 について

請求の範囲 15～20 及び 22 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 1～4 から新規性及び進歩性を有しない。文献 1～4 には、請求の範囲 1～5 及び 9～12 のいずれかに記載の化合物がうつ病や不安症、睡眠障害、過敏性大腸症候群等の疾患の予防又は治療に有用であることが記載されている。

また、請求の範囲 15～20 及び 22 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 1 及び 2 より進歩性を有しない。文献 1 には、請求の範囲 1～5 及び 9～12 に記載の化合物を包含する化合物群がうつ病や不安症、睡眠障害等の疾患の予防や治療に有用であることが、文献 2 には、請求の範囲 1～4 に記載の化合物を包含する化合物群がうつ病、不安障害、過敏性大腸症候群等の疾患の予防や治療に有用であることがそれぞれ記載されている。そして、医薬の分野において、薬理活性を有する化合物中の一部の構造を適宜変えて薬理活性の改善等を図ることは、通常行われていることであるから、文献 1 又は 2 に記載の化合物群に該当する化合物やその一部の構造を適宜変えた化合物を実際に製造し、上記疾患の治療活性を確認してみることは当業者にとっては自明のものである。